

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
10 mai 2001 (10.05.2001)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
WO 01/32654 A2

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup>:

C07D 407/12, 405/12,

413/12, 307/24, 263/24, A61K 31/353, 31/341, 31/404,  
31/422, 31/42, A61P 37/00, 29/00, 9/00

(21) Numéro de la demande internationale:

PCT/FR00/03067

(22) Date de dépôt international:

3 novembre 2000 (03.11.2000)

(25) Langue de dépôt:

français

(26) Langue de publication:

français

(30) Données relatives à la priorité:

99/13858 5 novembre 1999 (05.11.1999) FR  
00/06535 23 mai 2000 (23.05.2000) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US): SOCI-  
ETE DE CONSEILS DE RECHERCHES ET D'AP-  
PLICATIONS SCIENTIFIQUES (S.C.R.A.S.) [FR/FR];  
51/53, rue du Docteur Blanche, F-75016 Paris (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement): AUVIN,  
Serge [FR/FR]; 4, rue Chanteclair, F-91730 Mauchamps  
(FR). CHABRIER de LASSAUNIERE, Pierre-Etienne  
[FR/FR]; 134, quai Louis Blériot, F-75016 Paris (FR).

(74) Mandataire: BOURGOUIN, André; Beaufour Ipsen -  
S.C.R.A.S., Direction de la Propriété Industrielle, 42, rue  
du Docteur Blanche, F-75016 Paris (FR).

(81) États désignés (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ,  
BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE,  
DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO,  
NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR,  
TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) États désignés (régional): brevet ARIPO (GH, GM, KE,  
LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), brevet eurasien  
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen  
(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU,  
MC, NL, PT, SE, TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI,  
CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée:

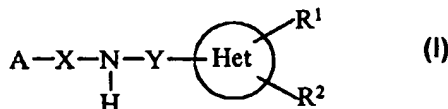
— Sans rapport de recherche internationale, sera republiée  
dès réception de ce rapport.

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abrégia-  
tions, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et  
abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de  
la Gazette du PCT.

BEST AVAILABLE COPY

(54) Title: NOVEL HETEROCYCLIC COMPOUNDS AND THEIR USE AS MEDICINES

(54) Titre: NOUVEAUX COMPOSES HETEROCYCLIQUES ET LEUR APPLICATION A TITRE DE MEDICAMENTS



(57) Abstract: The invention concerns novel heterocyclic derivatives having a calpain inhibiting activity and/or an activity trapping reactive oxygen species, of formula (I) wherein A, X, Y, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> and Het represent variable groups. The invention also concerns methods for preparing said compounds, pharmaceutical preparations containing them and their therapeutic use, in particular as calpain inhibitors and/or as trapping agents for reactive oxygen species, whether selectively or not.

(57) Abrégé: La présente invention concerne de nouveaux dérivés hétérocycliques présentant une activité inhibitrice des calpaines et/ou une activité piègeuse des formes réactives de l'oxygène, de formule (I) dans laquelle A, X, Y, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> et Het représentent des groupes variables. L'invention concerne également leurs méthodes de préparation, les préparations pharmaceutiques les contenant et leur utilisation à des fins thérapeutiques, en particulier en tant qu'inhibiteurs de calpaines et/ou piègeurs de formes réactives de l'oxygène, de manière sélective ou non.